

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

REC'D 22 APR 2005


PCT

WIPO

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054269	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/000708	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 28.01.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 06.02.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D521/00, C07D239/56, C07D403/04, A01N43/54, A01N43/56, A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 5 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 28.07.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 22.04.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Seitner, I Tel. +31 70 340-2389	



INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/000708

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-67

In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10

eingegangen am 28.07.2004 mit Schreiben vom 27.07.2004

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
 - ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/000708

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|---|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-10
Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche
Nein: Ansprüche 1-10 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-10
Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

D5: EP-A-0 293 743 (BASF AG) 7. Dezember 1988 (1988-12-07)

D7: WO 02/074753 A (RHEINHEIMER JOACHIM ; BASF AG (DE); GEWEHR
MARKUS (DE); LORENZ GISELA) 26. September 2002 (2002-09-26)

V.1. Neuheit:

Die Verbindungen gemäß den aktuellen Ansprüchen werden nicht im Stand der Technik offenbart. Daher ist der Gegenstand der Ansprüche 1-10 neu im Sinne von Artikel 33(2) PCT.

V.2. Erfinderische Tätigkeit:

Die vorliegende Anmeldung erfüllt nicht die Erfordernisse des Artikels 33(1) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-10 aus folgenden Gründen nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit im Sinne von Artikel 33(3) beruht:

Dokument D5 offenbart Fungizide (siehe Tabelle 2 und Anspruch 4), die sich vom Gegenstand des vorliegenden Anspruchs 1 dadurch unterscheiden, dass der Pyrimidin-Ring nicht durch 5-Phenyl substituiert ist, sondern zum Beispiel durch 5-alkyl.

Dokument D7 jedoch beschreibt Pyrimidine mit fungizider Wirkung, die an der Position 5 durch trifluoro-Phenyl substituiert sind (siehe Tabelle I und Ansprüche 1, 9, 10), so wie in den beanspruchten Verbindungen.

Daher würde der Fachmann, ohne erfinderisches Zutun, die in D5 und D7 offenbarten Merkmale miteinander kombinieren, um die Aufgabe der Bereitstellung weiterer Fungizide zu lösen.

Aus diesen Gründen kann die im unabhängigen Anspruch 1 vorgeschlagene Lösung nicht als erfinderisch betrachtet werden (Artikel 33 (3) PCT).

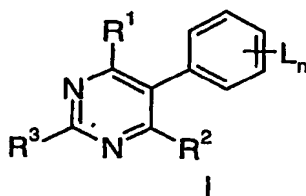
Der Anmelder wird darüber hinaus darauf hingewiesen, dass die Beispiele I-13, I-23, I-24 und I-37 nicht unter die allgemeine Formel I von Anspruch 1 fallen, da R1 als C1-C10-Alkyl definiert ist, oben genannten Beispiele jedoch substituierte Alkylreste als R1 umfassen. Dies betrifft auch die in Tabelle A angeführten Definitionen, wenn R1 A-27 bis A-41, A-50, A-107 und A-138 bedeutet.

V.3. Gewerbliche Anwendbarkeit:

Die in der vorliegenden Anmeldung beanspruchten Verbindungen sind für den Einsatz als Pestizide geeignet und daher wird der Gegenstand der Ansprüche 1-10 als gewerblich anwendbar angesehen (Artikel 33(4) PCT).

Patentansprüche

1. Pyrimidine der Formel I



5 in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n eine ganze Zahl von 1 bis 5;

10 L Halogen, Cyano, Nitro, Cyanato (OCN), C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkenyloxy, -C(=S)-N(A')A, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A;

15 m 0, 1 oder 2;

20 A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkenyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder durch Cyano oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sein können, oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen fünf- oder sechsgliedrigen gesättigten, partiell ungesättigten oder aromatischen Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

30 R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl;

R² Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy oder C₃-C₄-Alkinyloxy;

35 R³ fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer mono- oder bicyclischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L, R¹, R² und/oder R³ ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis vier Gruppen R^a tragen können:

5

R^a Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, OH, SH, zwei vicinale Gruppen R^a (=O) oder (=S) bedeuten können, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkenyloxy, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A')(=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A'')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A oder S(=O)_m-N(A')A, wobei m, A, A', A'' die vorgenannte Bedeutung haben und wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können, wobei R^b die gleiche Bedeutung wie R^a besitzt.

10

15

2. Pyrimidine nach Anspruch 1, in der Index und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

20

L Halogen, Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, -C(=O)-O-A, N(A')-C(=O)-A oder S(=O)_m-A,

m 0, 1 oder 2;

25

A, A', A'' unabhängig voneinander Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, wobei die organischen Reste partiell oder vollständig halogeniert sein können oder A und A' zusammen mit den Atomen an die sie gebunden sind für einen partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, stehen;

30

R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl;

35

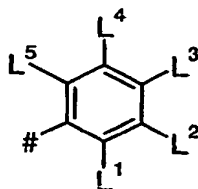
R² C₁-C₄-Alkyl, Cyano oder Chlor.

wobei die aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen der Restdefinitionen von L, R¹ und/oder R³ ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert

40

sein oder eine bis vier Gruppen R^a tragen können:

- 5 R^a Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkenyloxy, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ oder $S(=O)_m-N(A')A$.
- 10 3. Pyrimidine nach Anspruch 1, in der R^3 Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1,2,4-Triazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, Furanyl, Thiophenyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, 1,2,3-Triazinyl, 1,2,4-Triazinyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Hexahydroazepinyl oder Dihydropyridinyl bedeutet, wobei der Heterocyclus über C oder N an den Pyrimidinring gebunden sein kann und bis zu drei Substituenten R^a tragen kann:
- 15 R^a Halogen, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_{10} -Alkenyl, C_2 - C_{10} -Alkynyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, OH, SH, zwei vicinale Gruppen R^a ($=O$) oder ($=S$) bedeuten können, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkenyloxy, $-C(=O)-A$, $-C(=O)-O-A$, $-C(=O)-N(A')A$, $C(A')(=N-OA)$, $N(A')A$, $N(A')-C(=O)-A$, $N(A'')-C(=O)-N(A')A$, $S(=O)_m-A$, $S(=O)_m-O-A$ oder $S(=O)_m-N(A')A$.
- 20 4. Pyrimidine nach Anspruch 1, in der R^3 Pyrazol-1-yl, [1,2,4]-Triazol-1-yl, Pyridin-2-yl, Pyrimidin-2-yl, Pyridazin-3-yl, Pyrrolidin-2-on-1-yl, Piperidin-2-on-1-yl, Hexahydro-2H-azepin-2-on-1-yl, Pyrrolidin-2-thion-1-yl, Pyperidin-2-thion-1-yl, Hexahydro-2H-azepin-2-thion-1-yl, 1,2-Dihydropyridin-2-on-1-yl.
- 25 5. Pyrimidine nach Anspruch 1, in der R^2 Methyl, Chlor oder Ethyl bedeutet.
- 30 6. Pyrimidine nach einem der Ansprüche 1 bis 6, in der die durch L_n substituierte Phenylgruppe für die Gruppe B



B

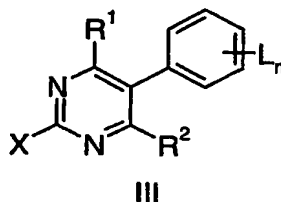
steht, worin # die Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidin-Gerüst ist und

- 35 L^1 Fluor, Chlor, CH_3 oder CF_3 ;
 L^2, L^4 unabhängig voneinander Wasserstoff, CH_3 oder Fluor;

- L³ Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, CH₃, SCH₃, OCH₃, SO₂CH₃, CO-NH₂, CO-NHCH₃, CO-NHC₂H₅, CO-N(CH₃)₂, NH-C(=O)CH₃, N(CH₃)-C(=O)CH₃ oder COOCH₃ und
- L⁵ Wasserstoff, Fluor, Chlor oder CH₃ bedeuten.

5

7. Verfahren zur Herstellung von Pyrimidinen der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei R³ für einen stickstoffhaltigen Heterocyclus steht, der über Stickstoff gebunden ist, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel III,

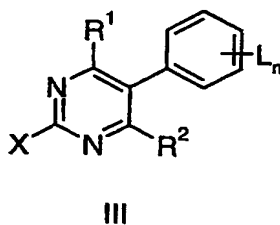


10

- in der die Substituenten L_n, R¹ und R² die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und X für Halogen, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfoxy oder C₁-C₆-Alkylsulfonyl steht, mit einem Heterocyclus der Formel R³-H (IV) gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt.

15

8. Zwischenprodukte der Formel III,



20

- in der die Substituenten R¹ die in Anspruch 1, L_n die in Anspruch 2, X die in Anspruch 7 gegebene Bedeutung haben und R² für Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy oder C₃-C₄-Alkynyloxy steht, wobei die Alkyl, Alkenyl und Alkynylreste von R² durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₂-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sein können.

25

9. Pestizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

10. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materia-

30

lien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.